REPUBLIC OF YEMEN
21 September University Of
Medical & Applied Sciences
Faculty of pharmacy

بسم الله الرحمن الرحيم

الجمهورية اليمنية
جامعة ٢١ سبتمبر للعلوم الطبية والتطبيقية
كلية الصيدلة

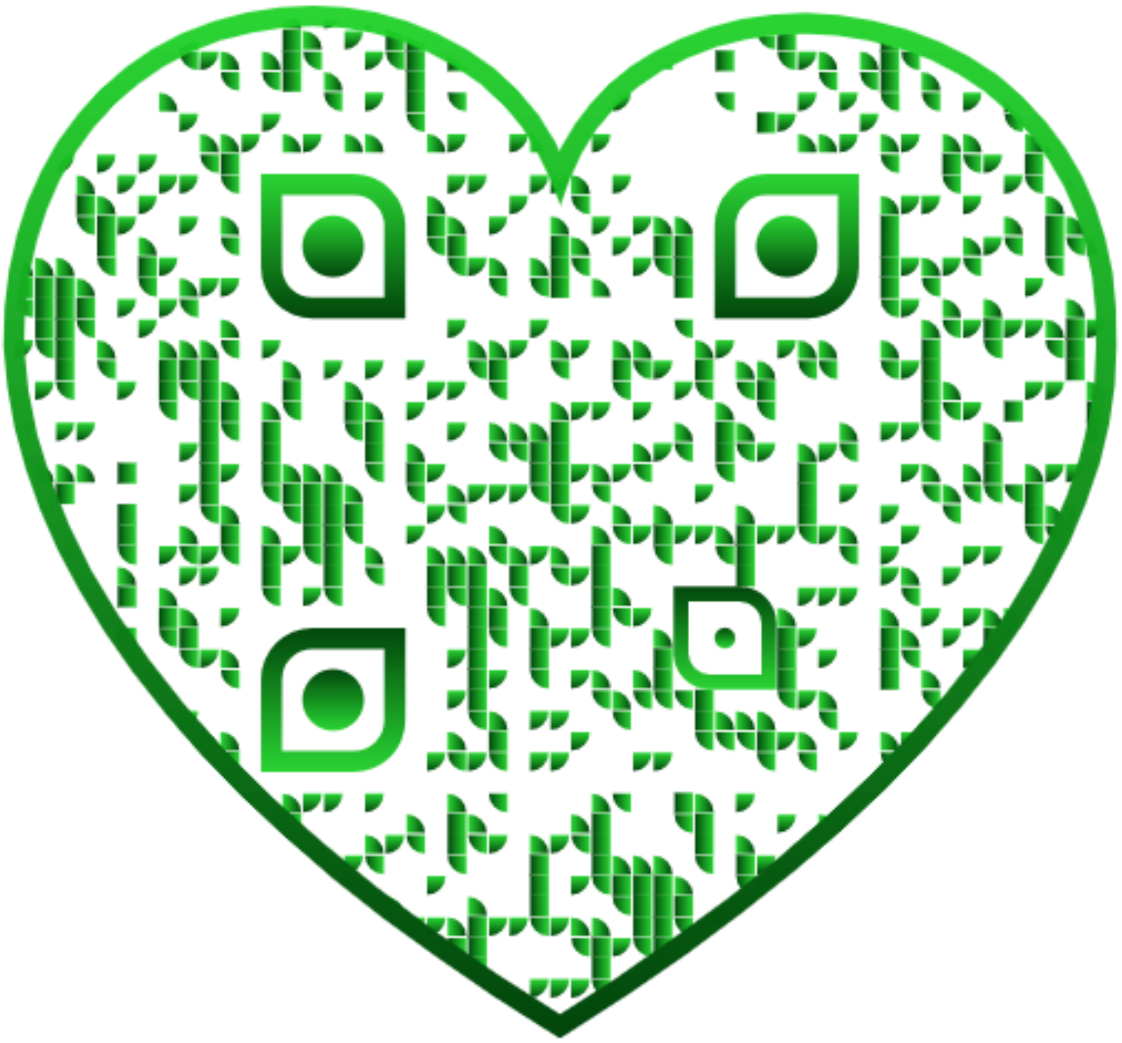
CLINICAL PHARMACY
قسم صيدلي

اللجنة العلمية لكلية الصيدلة الدفعة الثانية

ملخص لمادة: كيمياء دوائيه المحاضره 7 و 8

عمل طلاب المجموعة: المجموعة الـ6 سادسة6

Scanned by CamScanner



(8+7) محاضرة

Day / / ①

محاضرة كيمياء دوائية

ANS (nervous system)

CNS

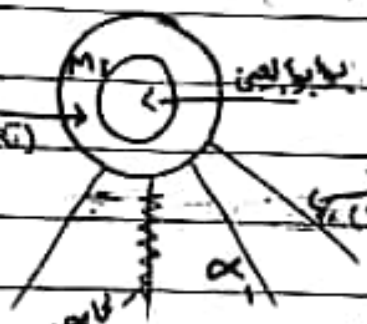
Peripheral

ANS

Somatic

Sympathetic
(استطارة)
ماذا يحل للشخص في حالة تعرضه لشغل
السمبتاوي فيحل
1- انصباب الدم (يحل الـ Vasoconstriction)
2- يحل الـ mydriasis (يحل الـ contraction لـ radial muscles)

Parasympathetic
(راحة)



* يحل الـ radial انقباض فبالتالي
الانصباب طويلة يحل لها انقباض
توسع العين وتحل mydriasis
* اما الـ circular استرخاء يحل لها جار السمبتاوي
ايضا يحل لها انقباض وتحل miosis
3- يحل dryness (dry mouth)
يحل لأن الغدة في السمبتاوي يحل لها sphincter contraction

وبالتالي يقل الإفراز سواء اللعاب او لغيره

يحل إمساك واحتباس الـ urine لأن الـ sphincter تنغلق

Scanned by CamScanner

Day / /

Sympathetic تابع ال

(4) في ال branchi
يصل للقصبة الهوائية (bronchodilation) عشان تأخذ اكبر كمية هواء ممكن
إما لكراوفر (هروب او قتال).

(5) في القلب يصل
+ve chronotropic & +ve dromotropic & +ve inotropic
معناها ↓ معناها ↓ معناها ↓
انقباض heart rate توصيل
(يعني اما يزيد الانقباض يزيد التوصيل وبالتالي يزيد heart rate

(6) في الرحم
يصل relax (لوكان السمبثاوي اول ما تشغل العادة لحاول تقبضه
لكانت العادة اول ما تشغل يصل ابهاض ولكن بحان الله
السمبثاوي لايعمل انقباض على الرحم اثناء اشغل العادة لحاول
واغايعمل relax)

(7) هذا يوصل لـ sphincter كل
تقلصات (closed) ← contraction

(8) الـ muscles
يوصل لها ← relaxation

أما الكاسمبثاوي * parasympathetic ← يضيق في حدقة العين (تقل الرؤية)
* اللعاب يتزيد (salivation) يقلك لو احد ضاربك، ولعابه نزل اضربه قبل
مايجف لانه لو جف كيشتغل بعدين الـ Sympathetic
* في الـ branchi يصير vasoconstriction ← (Asthma) أزمة
* في القلب -ve inotropic & -ve chronotropic & -ve dromotropic
* الـ Sphincter ← تنفتح (relaxation)

BIZRS

Scanned by CamScanner

α_1

موجودة في الـ (post synaps)

- الـ α_1 موجودة في الـ:

1- main blood vessels

2- smooth muscles of main B.V

بحيث انه يوصل الى الـ tank لخزان الدم في الاطراف يعني يحصل فيها انقباض وليس انقباض عن العضلات الملساء في الاطراف فيها α_1 هي المسؤولة فيحصل في الاطراف strummer من قوة الدم الذي وصل للاطراف.

3- Main arteries and main viens.

3- eye → Mydriasis

4- sphincter

Uses

1- hypertension

2- congestion → decongestion

لا ينصح باستخدام ادوية الزكام في حالة ارتفاع الضغط لانها ترفع الضغط.

الامراض: ضغط - امراض القلب

α_2

موجودة في الـ presynaps

ولماذا سُمّيت pre يعني انا النورادرينالين ما يرجع يشتغل على الـ post وجودة في الـ CNS وجودة في الدماغ يعمل:

- sympathetic outflow لـ

- كان موجود pre ولما انتظم يعني يمنع خروج النواقل.

ولما يقل الـ sympathetic outflow يقل الضغط الدماغي يعني ↓ ICP

من أهم وظائف α_2

1- ↓ sympathetic outflow

2- ↓ ICP

intracranial pressure

β_1

موجودة في الـ post

موجودة في:

1- heart

2- Kidny

3- Coronary arteries

Uses الـ

تعالج بـه

1- hypotension

2- Brady cardia

من الـ side effect الي ممكن يعملها β_1

1- hypertension

2- [redacted] tachycardia

β_2

موجودة post

موجودة في:-

1- lung

2- smooth muscles of blood vessels (في الأطراف)

3- liver

4- uterus

Uses الـ

1- Asthma

2- contraction of uterus

هذا الادوية تقطع في حالة انقباض الرحم عشان تمنع الولادة المبكرة

3- ↑ insuline

case of hypoglycemic

4- ↑ سكر

يزود السكر عشان يعطي طاقة

لانه الانسولين بنزل مع سكر

β_3

موجودة post

lipolysis تعمل

يعني تكسر الدهون

اي طاقة

موجودة في

adipose الـ

مشاكل الـ β_2 انها تعمل hypoglycemia مع مرضى السكر فقط لانه مرضى السكر الطبيعي لما الانسولين ينزل للدم يدخل السكر للخلايا ولا يحصل hypo لانه يحصل تنقل سكري بالكبد وتحلل الدهون

Scanned by CamScanner

Day / /

- المتحكم في الـ GIT هو الباراسيمباثي يؤثر كلية بشكل قليل جداً
- المتحكم في القلب هو الـ Sympathetic ← لورونا هنا جرعة الباراسيمباثي تؤثر على القلب ولكن نحتاج جرعة عالية

كأن الـ سيمباثي هو ← Para antagonist والعكس
وكأن الباراسيمباثي ← Sympathetic antagonist والعكس

هنا لما نقول Sympathetic antagonist وكأننا نقول parasympathetic. ولكن ليس بنفس القوة
ولما نقول هنا parasympathetic agonist كأننا بتكلم para antagonist ولكن ليس بنفس القوة

المتحكم في الـ Sphincter هو الـ para وكذلك الشيء يعمل بقلي الـ neurotransmitter اقوى من الـ para فيتحكم الـ sympathetic ويقفل كل الـ Sphincter.

الـ para هو يشتغل اثناء الراحة
اكثر الادوية في الجسم هي الـ Sympathetic

هناك قاعدة بشرية مضبوطة 100٪
كل فرد فيه انقباض وكل زوجي انبساط هنا:-
α_1 ← انقباض contraction
α_2 ← انبساط dilation

BIZRS

Scanned by CamScanner

Day / /

الـ Propranolol

اكبر اض جانبيه لـ propranolol هي peripheral vascular disease

Asthma و diabetic hypoglycemia

مش كل الناس تقصد تعمل هذة الاعراض

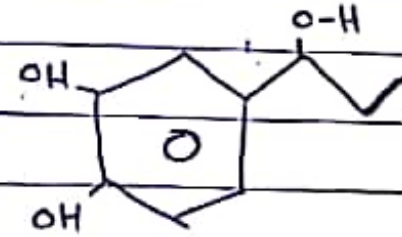
في حالة كانا معانا دواء يعمل بردودة في الاطراف نحول الدواء الى β ما يعملش ازعه

وكذلك يعمل برودة في الاطراف

الأهم هو كيف اصنا اصحاب شركة ادوية تصمم ادوية وتنزلها

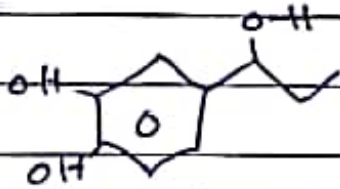
من خلال القاعدة ← ① الحجم اكبر يعني antagonist

← ② نفس الشكل والحجم والروابط يعني agonist



Adrelanine (الأب)

أما الـ noradrenaline (البنت) نفس الـ adrenaline بس من غير Methyle



Noradrenaline (البنت)

ربنا خلق في السمباوي حاجة اسمها ganglion عبارة عن نقطة (توصيل)

ليك الـ autonomic nervous system ← يوجد ganglion فيها كتير

لو لقيت الـ ganglion قريب فهي sympathetic ولكن بعيد فهي parasympathetic

↓ ↓

يعني الـ pre قليل post كتير (عكس) يعني الـ post قليل pre كتير (عكس)

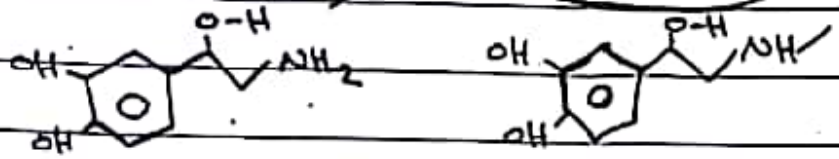
BIZRS

Scanned by CamScanner

Day / /

الإلهام ماخوذ من الجانب العصبي خلق من شأة من الـ thoracic هو شوية lumbar
اما البارفين فأمن sacrum و coccyx ال sacrum من الفقرة الثالث
والسابع والتاسع والعاشر (III, VII, IX, X) ثلاثة فردي وواحد زوجي

الناس اللي بيتخذ هو العلاج بالقرآن الأصل ان الجن يقرأ عنده عن غير ما يلمس المريض لان الشخ
احيانا يضغط بحت الخلق فيشغل البارفالمريض يفقد وعيه احيانا بسبب الضغط على العصب
العاشر (الحائر) الذي ينظم الضغط وينظم supply الصمام والتعادل والموازنة لان
السمبتاوي والجار سمبتاوي ضروري يكونين في حالة اتزان



Nor adrenaline Adrenaline

دائما مستقبل α اصغر من β ← β > α كذلك
الـ Noradrenaline يشغل α اكثر من β لانه اصغر من الادرينالين والاصغر
هو الذي يشغل α بسهولة
أما الادرينالين فهو يشغل β اكثر لان β كبير والادرينالين معاه CH3 كبير
+ الادرينالين يشغل β > α
+ النورادرينالين يشغل α > β

سؤال هامعين β اكثر من α ؟!
يعني يشغال على القلب اكثر من الاوعية (الاوردية وغيره)
هامعين α اكثر من β ؟!!
يعني يشغال على الاوعية اكثر من القلب

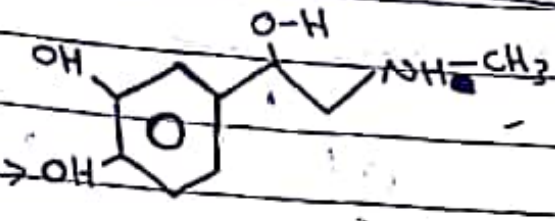
ندرس بعض نقاط الضغط
الضغط بشكل عام يوصل لمرحلتين 1) يا بتوقف الـ pump نخففها او تخفق الصمامات
2) او تخفق اكثر من يوم

BIZRS

Scanned by CamScanner

Day / /

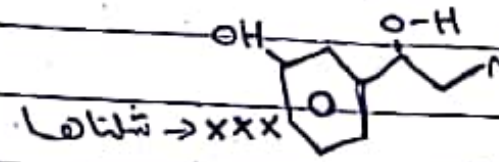
ليس بعض الناس يقول ك اذا تشتي هادج المضغط انتشل المواصير بدل هادوقفها ايفيني
توسيع الاوعيه فيقل الضغط
كان قبل β بلوكر يعني تخفض ال pressure الآن الافضل تشتغل على المواصير
والقلب نخليه على ماهو ويشتغل الاغيطاله ال engine والـ MI
اما اذا ماقيشر ك MI و engine فنروح للمواصير افضل ك ثانيا ماتشتغلش ك
arrythmic وكذيره
لما نعالج بال α هي فقط اللي تقلل xanthine اما ك ماتقللش



هذا الدواء β كما ما ← تقصر طوله يرجع α

كان تنقص الطول الافضل تخيل ال pores الرجل افضل هنا ليه كان تقصر الطول

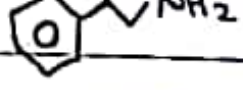
فيصبح الدواء



الدواء α_1 agonist

ماعيلجش يشتغل β وانا كان α يشتغل في حالة الـ congestion و في حالة الـ hypotension
ليش شلنا الـ OH كنا حطها السالبة كانت فنقصناها كان يقصر الدواء وبالتالي يدخل فقط
α وحتى لو دخل β يكون ضعيف ما يشتغلش
يعني لو بعدنا الـ CH يرجع الدواء α بدل ما كان β ولو بعدنا الـ OH (pores) كان
يرجع α برضه ما كان β لان الـ OH كبيرة فنقصت الطول. ولو بعدنا الـ CH مع الـ OH
مرة واحدة نفس الشي يرجع α كنا حنا نقصنا طوله

هل يدخل α ام β ؟؟ الدواء

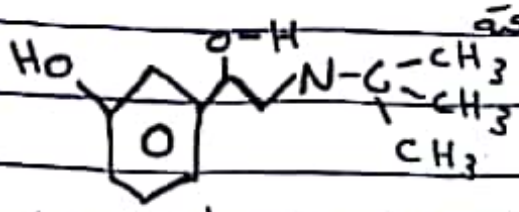


يدخل α

BIZRS

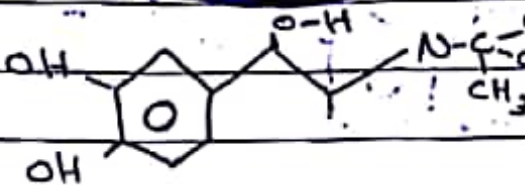
Scanned by CamScanner

جاءت شركة أدوية غيرت الدواء ورجعته



كيرنا الدواء الدواء رجع β بدله ماكان α يعني اصبح antagonist الـ α يعني وكان الـ CH_3 نفصلها زيدنا تقريباتها اكثر شان ماتدخلش α وانضا β احنا وجدوا ان هذا الدواء يدخل $\beta_3 < \beta_1 < \beta_2$ فقالوا مجازاً β_2 ومادام هو β_2 اكيد كيعالج الـ Asthma و hypotension و Congestion من ضمن الادوية اللي هي β_2 agonist وتعالج اكثر منه هي

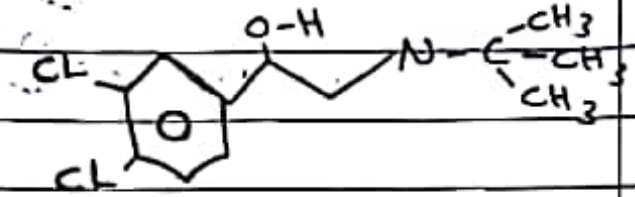
لوكيرنا الدواء



أصبح β-antagonist

أيش هدول أضافوا OH

جاءت شركة ثانية وقالت لويزنا هنبدل الـ OH بـ Cl



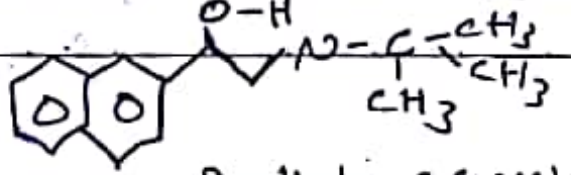
الـ Cl حقه الـ البيه اللي من الـ OH

كانوا ايستو بكبروة بكي الدواء ماتقريش على انه β_2 agonist سؤال أيش عندهي دواء يشتغل كـ β_2-agonist ؟!!

فيه ازمة

عندهي ادوية اسمال تعرفي فيه salbutamol عشان لوفي اتعب بالنفس - ماهي الاعراض اللي عندي يصاب بها المريض نتيجة استخدام الـ β_2-agonist Tachycardia - Tremmur (بعض الناس وليس كل الناس) وهو يشتغل على القلب بنسبة خفيفة

هنالك كلام إسمه black يعني الـ ماء الي وعمل حلقين وفلاة زي ما هو

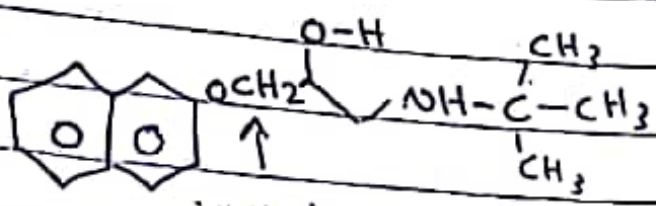


مازال partialy agonist

Scanned by CamScanner

ماعنا partialy agonist يعني انه شغال ٣٠٪ و antagonist ٧٠٪ يعني انه شغال agonist ٣٠٪ بشيء بسيط و antagonist ٧٠٪.

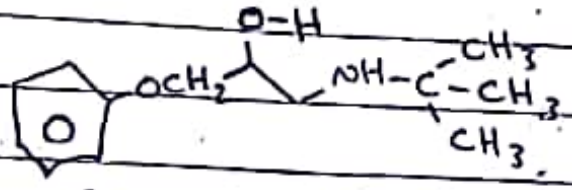
فقاموا كيروة (زودوا بالشحم)



زودنا بالشحم

Propranolol (β antagonist).

اكسدوا β antagonist تلاقي انزيم ايتوه اما antagonist ← β_1 و β_2 ← جاية شركة وقالت هذا الاسم propranolol شغال β_1 و β_2 وجاءت شركة وقالت لا بدنا الكلمة وخليناها واحدة فيصبح β_1 antagonist



β_1-antagonist

اكسدوا branched هو β_1 بلوكر antagonist وكانز ذيج الشحم

α_1-antagonist استخداماتها قليلة جدا تعمل reflux tachycardia وتعمل edema (Na and H_2O retention) كان لما يتقص الدوكسازوسين يشتغل الالدوستيرون فيعمل احتباس للماء والملح يعني.

اكو مركب branch بالطرف ومعاه OCH_2 بالنص ليعني انه antagonist

تنظم ضربات القلب

لو زدنا الجرعة (أزمة)

BIZRS

Scanned by CamScanner

(15) (التوصيل Sympa والناقل para)

Day / /

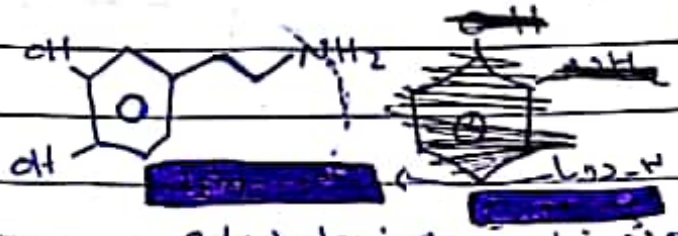
في السمباثاوي الناقل هو ادرينالين ونورادرينالين والمستقبلات هي α و β
في الباراسمباثاوي الناقل هو ايتايل كولين والمستقبلات muscarenic و nicotinic

جوه في الصيدلة نركز على β_1 و β_2 و α_1 و α_2 و β_3 و α_3
كون ان β_1 محجوزة القلب و الـ M_2 محجوزة القلب
يقيه الجسم شغاله M_1 و M_3 لحابش دراسات عليه كتيرة وما فيش M_1 او M_3 كالة)

(التوصيل Sympa والموصل او الناقل para)

الـ propranolol اللي بيستخدمه شخص بيسبب حرقة بالرغم ان السمباثاوي مش شغال (الموصل بارد) ولا يستطيع الـ propranolol انه يوقف الـ AC

في حاجة اسمها catecholamine الأساسي كول معناها حلقة و ol معناها فينول الكحول



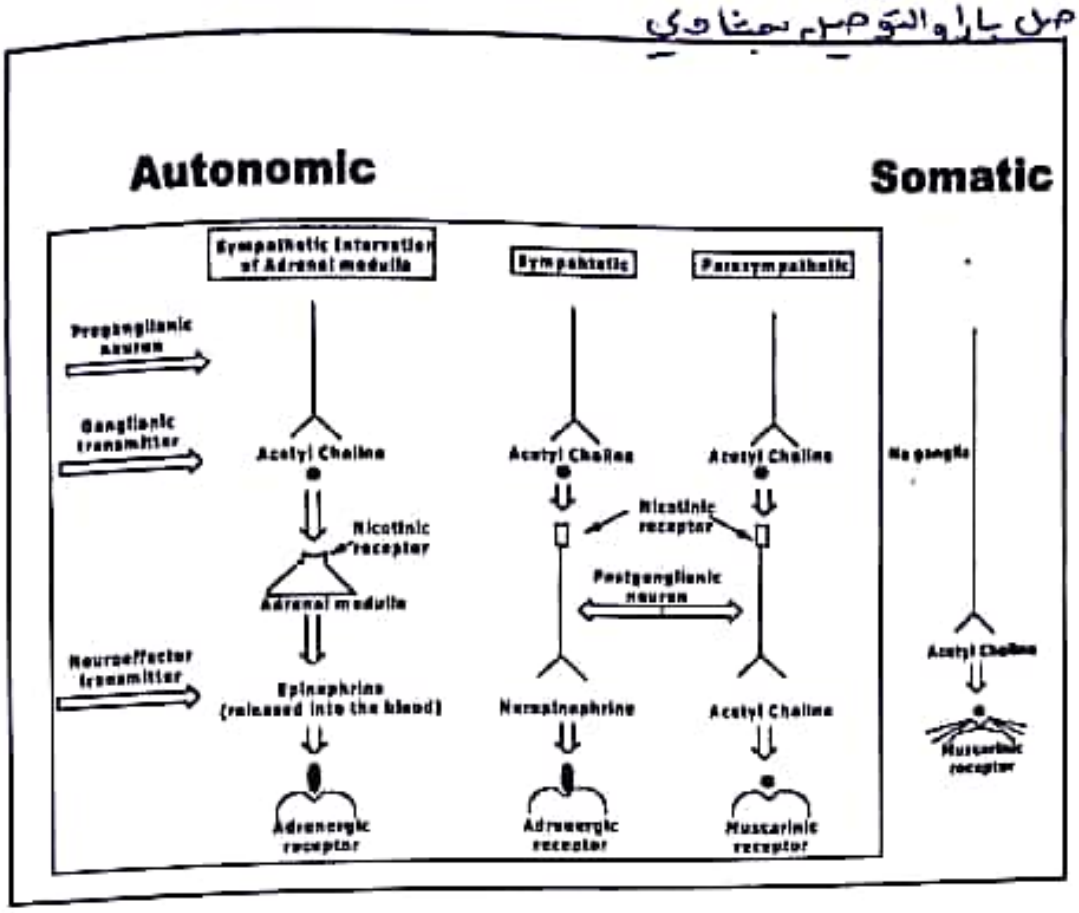
التاي كول أمين في جسمنا
هي ١- ادرينالين ٢- نورادرينالين ٣- دوبا
يعني اي حاجة بتنتهي فيها OH مع أمين بسمى catecholamine
لو ارتفع الأدرينالين في الدماغ يحصل جنان (mania)
- اذا ارتفع الدوبامين في الدماغ يقل الايتايل كولين ويسبب هلوسة
- لكن اذا ارتفع السيروتونين مع النورادرينالين نهو يسبب (جنان)

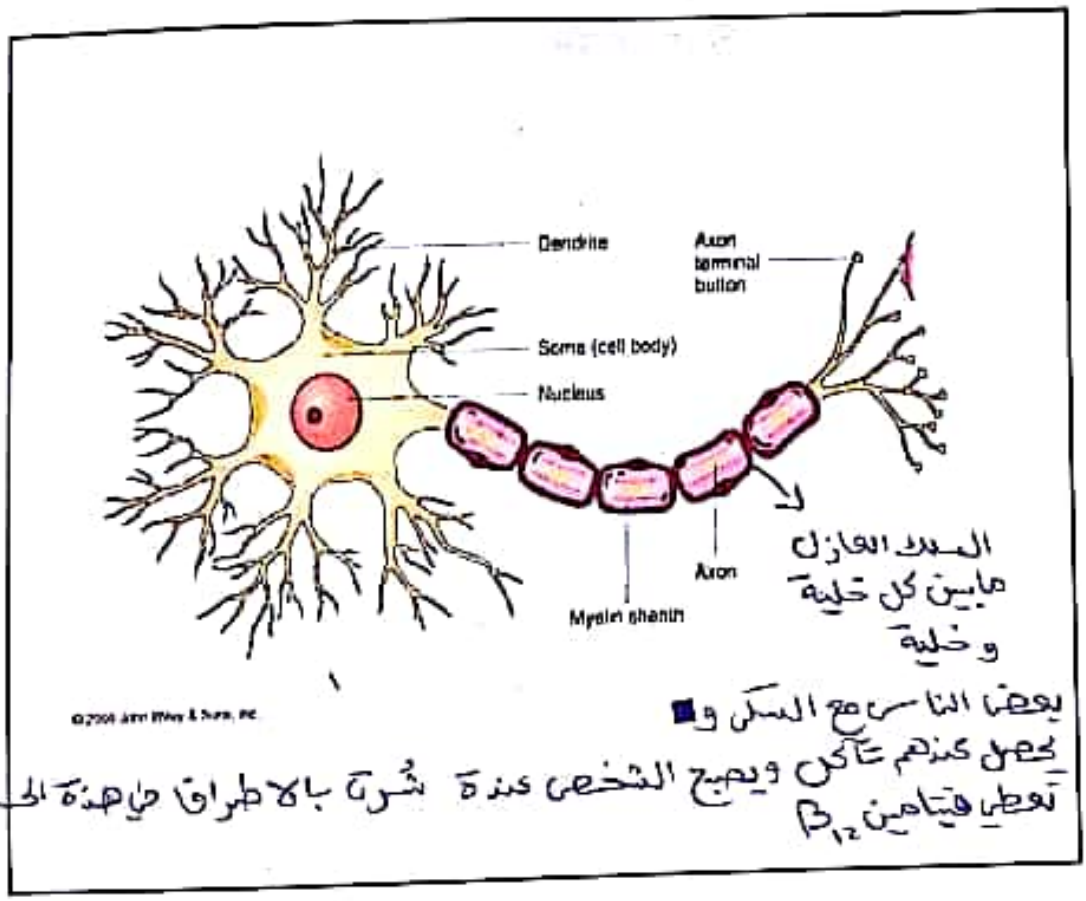
لو كان عندك شخص هبوط ادرينالين severe hypotension ما نصرف !!!
في هذة الحالة نعطي adrenaline
لان الشخص الذي عنده هبوط حاد يدي حالته خطيرة. ففي هذة الحالة نزود الضغط
اعمل اقوى من المواضير

BIZERS

Scanned by CamScanner

الموصل بارا والتوصيل بمشاوي

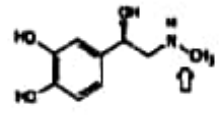
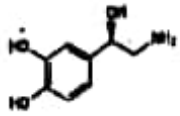
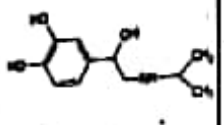
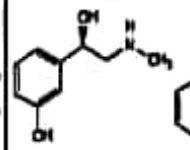
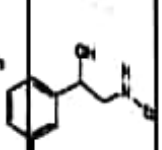


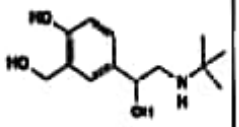
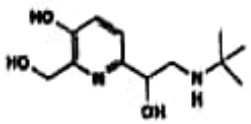
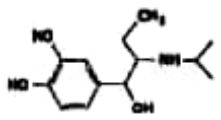
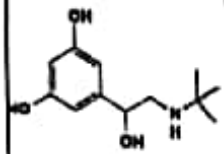


العزل الغازل مابين كل خلية وخلية

بعض الناس مع الأكل و يحصل عندهم تأكل ويصبح الشخص عنده شرة بالاطراف فهذه الحالة تعطى فيتامين B_{12}

Scanned by CamScanner

Adrenaline (E)	Noradrenaline (NE)	Isoetrenol	Phenylephrine	Etilefrine (Effortil®)
 Larger substituents on this nitrogen shift selectivity toward beta receptors		 (فخيخ وفش عوجود بالبين PROTOTYPE		
α & β agonist (mixed)		Pure β-agonist	Pure α-agonist	Pure α-agonist
Uses: 1.Treatment of severe hypotension. 2.Locally to stop bleeding. 3.Smooth muscle relaxation		Bronchodilator	Nasal decongestant	Treatment of mild hypotension while Adrenaline used in severe hypotension

Salbutamol (Ventolin®)	Pributerol	Isoetharine	Terbutaline
			
Short acting 2-tert-butylamino-1-(4-hydroxy-3-hydroxymethylphenyl) ethanol	less muscle tremors		
Used for treatment of the asthma			

Scanned by CamScanner

Adrenergic binding site.

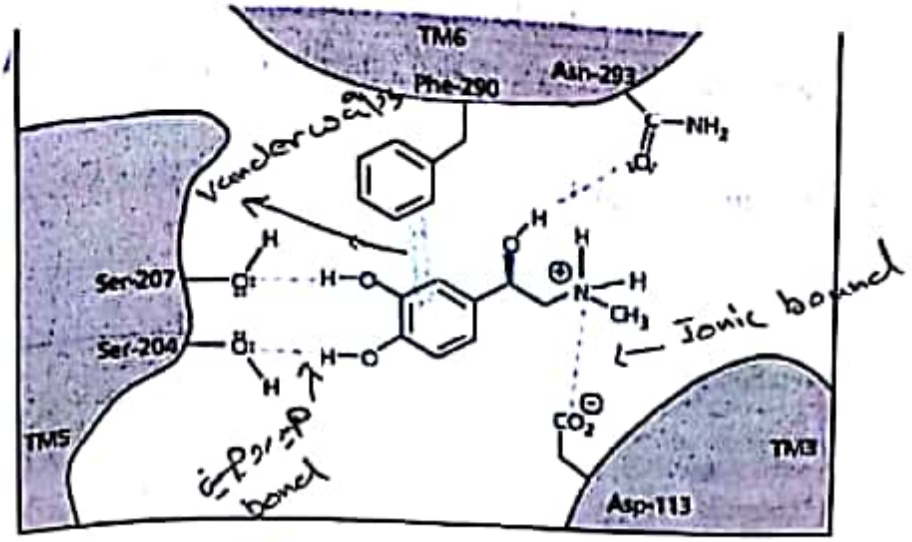


FIGURE Adrenergic binding site.

Structure-activity relationships

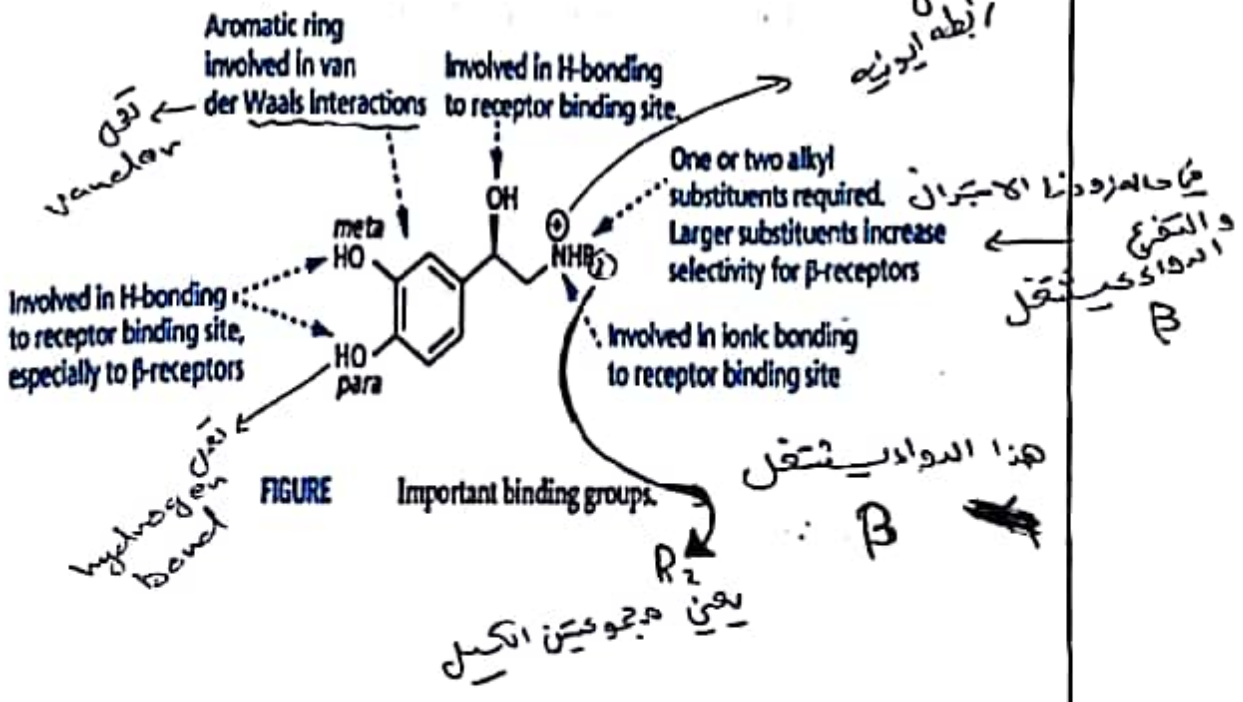

Aromatic ring involved in van der Waals Interactions
Involved in H-bonding to receptor binding site.
One or two alkyl substituents required. Larger substituents increase selectivity for β-receptors
Involved in H-bonding to receptor binding site, especially to β-receptors
Involved in ionic bonding to receptor binding site
meta
para
OH
NHR2

FIGURE Important binding groups.

Scanned by CamScanner

β_2 Agonists and the treatment of asthma

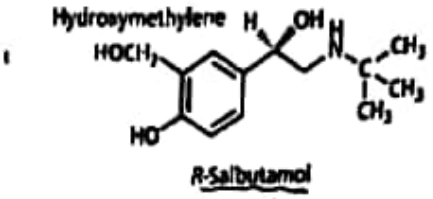
مع α ومع β

Adrenaline non selective interacting with all adrenergic receptors

Isoprenaline nonselective interacting with all β subtypes receptors

فقط مع β يعني β_1 و β_2 و β_3

Salbutamol selective β_2 Agonists



R-Salbutamol

Selective β_2-agonists.

مثال على β ( ) السالبيوتامول فيه منه S ومنه R وجدوا ان الـ R فعال اكثر من الـ S

هو يفعال اما بالنوع S فهو يكون فعال او فعاليته اقل

فالدخله مو α ما بهاش دخل بالاوعيه لان α_1 يكون موجود بالدماغ

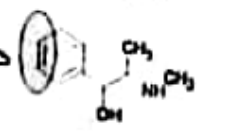
Direct and indirect acting sympathomimetics

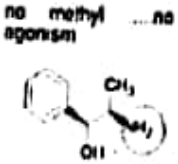
no catechol ... good CNS penetration, reasonable duration of action

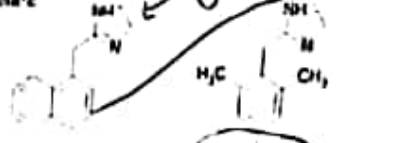
الحلقه فاضيه

no methyl ... no beta-2 agonism

وغيابها الحلقه قللت الـ α متحركه







Ephedrine

هذا الدواء تشغل α_1 لانه بانتشن على الحلقه اي حاجه

Phenylpropanolamine (Propadrine)

تشغل α وقفوة عالميا كانا يستخدم زمان اعراض للزكام لانه يعمل vasoconstriction فيعمل تزيق قوية α_1 agonist لانه حوكه الـ

Naphazoline (Presoline)

2-(1-naphthylmethyl)-2-imidazoline

استخدامه قفل الـ α وخلاها مش branchodilator و كان الـ α مش متفرقة اصبح في هذه الحاله تشغل α

Xylometazoline (Otrivin)

متفرع حلقه الدواء هذا يشتغل متفرع لانه agonist β_2

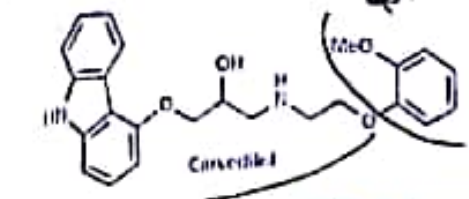
Scanned by CamScanner

هذا الدواء يسمى (mixed)

Adrenergic receptor antagonists

General α_2، β_1-blockers

Carvedilol and labetalol are agents which act as antagonists at both the a- and p. adrenoceptors. They have both been used as antihypertensives, and carvedilol has been used to treat cardiac failure.



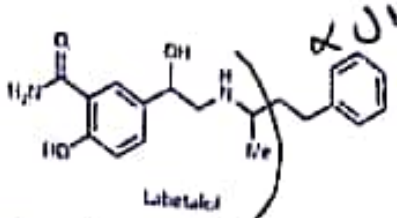


FIGURE 23.21 General α,β-blockers

α شغال
β شغال
فاجمع الدواء شغال α و β
β شغال
الجهاز يشتغل
لذا فهذا الدواء يعتبر mixed
β شغال
α شغال
يشتغل كله mixed
α و β

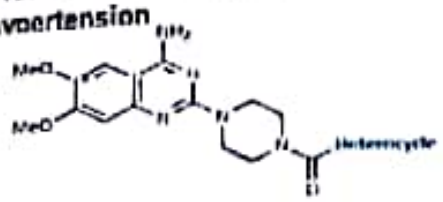
α1 antagonist تشمله هذين يستخدم في الضغط ولكن بنسب قليله جداً لذا يحتاجه يتم ابعادها بالموقع prostate
α-bloker zosine فهي تعتبر

α -Blockers

In general, α -antagonists have been limited to selective (antagonists, which have been used to treat hypertension or to control urinary output.

α1 selective antagonist

Prazosin was the first α1 selective antagonist to be used for the treatment of hypertension



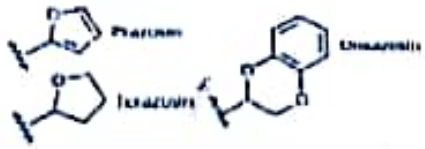


FIGURE 23.22 α1 Selective antagonists

الناس الي عندها heart failure مايصلحش تعطيها Nifedipine لانه يوقف القلب ويخل المريض بمشاكل

α2 selective antagonist

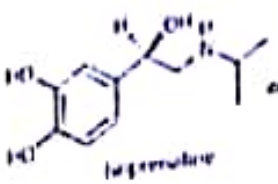
α2 -Antagonists are being considered as antidepressants. Depression is associated with decreased release of noradrenaline and serotonin in the CNS, and antidepressants work by increasing the levels of on of both of these neurotransmitter.

هذة الادوية ضعيفة تقابل الاكتئاب ويكتبها حتى موجودة بكثرة

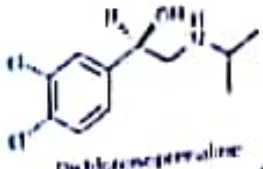
Scanned by CamScanner

β Blockers as cardiovascular drug

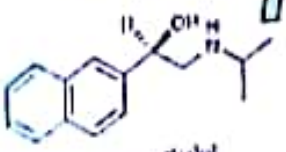
هذا العالم ابتدى بالاك قام غير الOH بـ ال كشان
يخلي الدواء antagonist ولكن الدواء ماتغيرش
فقام عمل حلقتين كمان الدواء ما رجعش
partialy-agonist واصابع
يعني antagonist(70%) و agonist(30%)



Isoproterenol



Dichloroisoproterenol



Pronethalol

The product obtained (pronethalol was still a partial agonist, but was the first β -blocker to be used clinically for angina, arrhythmia, and high blood pressure.

FIGURE 23.24 Partial β agonists

propranolol

فلما قام هذا العالم وعمل بالوسط OCH_2 رجع الدواء antagonist
يعني اي دواء معاة ما بين الحلقات ويقيد الدواء OCH_2 يعتبر β-antagonist

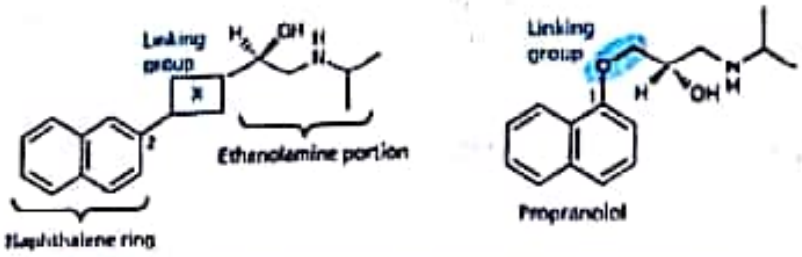


FIGURE Chain extension tactics and the discovery of propranolol.

It was introduced into the clinic for the treatment of angina .Its contribution to medicine was so significant that its inventor James Black got the Nobel Prize in 1988. The S enantiomer is the active enantiomer although propranolol is used clinically as a racemate.

Scanned by CamScanner

تابع استخدامات البروبرانولول ضد الـ B.V

1- heart
2- anxiety
3- migraine
4- hyperthyroidism
5- الناس اللي بيتأثر بواخر لما بتوقف الخزلينه
فيصل palpitation سريع وبالتالي توطي
sinderal - اللي بتنظم ضربات
القلب حقه (كذلك في المخدرات)
6- في السكر الانسولين يدخل
السكر للخلايا فيصل reflux
للمعدة وفي توقف ويصل
hypoglycemia

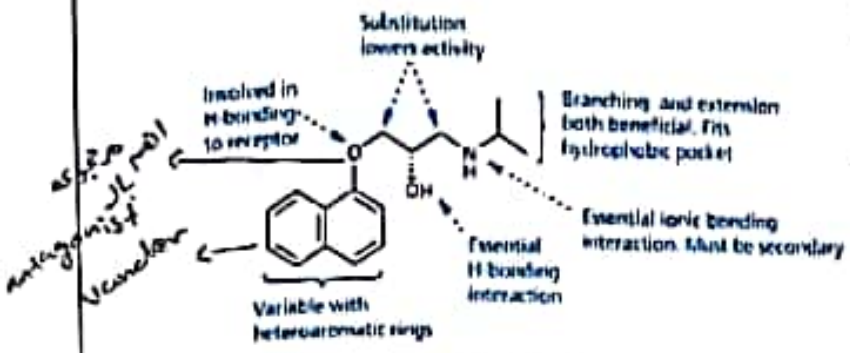

Substitution lowers activity
Involved in H bonding to receptor
Branching and extension both beneficial. Fits hydrophobic pocket
Essential ionic bonding interaction. Must be secondary
Essential H bonding interaction
Variable with heteroaromatic rings

FIGURE 23.26 Structure–activity relationships of aryloxypropanolamines.

هاد الحقه معالجة الخمرة والمخدرات ← لما يصير palpitation او غيرة
لتعرف اعراض الانسحاب

2: β adrenoceptor antagonist (β adrenergic blocking)

A: Non-selective β-adrenoceptor antagonist

Propranolol (inderal)

Pharmacokinetics		- It has low bioavailability when given orally due to fast pass effect.
Pharmacological	Heart	- (-ve) Inotropic & (-ve) Chronotropic (HR). - (-ve) Dromotropic (Slowed AV conduction). - Decrease cardiac work and O_2 consuming → useful in angina.
	Blood Vessels	- Blocking β_2 on the skeletal muscle → Block VD. - VC due to unopposed α receptor (blocking β receptor → All adrenaline and noradrenaline act on α receptor cause VC). - VC → Cold extremities and intermittent claudication. - Decrease blood flow to all organs except the brain.
	Blood Pressure	- Prolonged (4 weeks) administration → Hypotension → *due to* 1: Blocking β_1 of heart → Decrease CO. 2: Blocking β_1 of CNS → Decrease sympathetic outflow. 3: Blocking β_1 of Kidney → Decrease rennin release. 4: Blocking presynaptic β → Decrease NE release. 5: Resetting the sensitivity of baroreceptor. 6: Increase vasodilator prostaglandins (PGI$_2$).

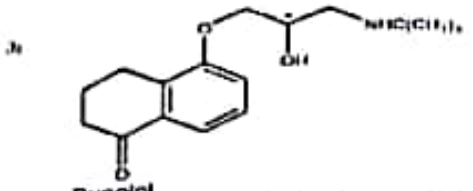
ينقص ضربات القلب
توصيل القلب يستخدم
في حالة الـ angina
والـ arrhythmia
يقي من الجلطات
ويمنع تكرر في الدماغ
بعض الناس
ايضا في العين حالج
و β_2 يعني smooth
فعالستروله يصل
كان الـ V-D في القلب
فيصل احتقان ← ضيق
← تضيقة فعالستروله
بروبرانولول يوقف
و بالتالي عالجنا الصداع

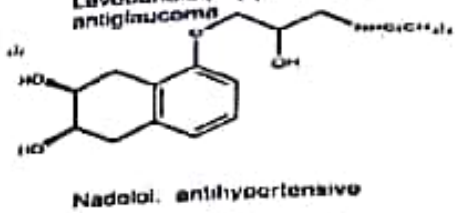
+ حقنة الربع 133 ← وبالتالي (anxiety)
يصل وسائل داخل الـ palpitation في القلب فيخلي المتخصص هزة فوبيا الامتحان ففي هزة الحالة تعمله
لـ ايضا يعالج (inderal) propranolol هاد الوقت اصلا hyperthyroidism
ايضا يعمل على تنظيم ضربات القلب هذا الـ B2 والبروبرانولول يوقف تحول T4 الى T3 اللي في الجسم

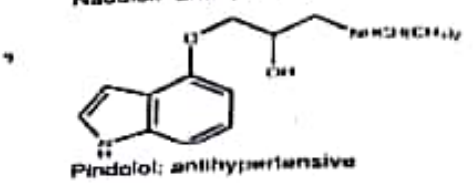
Scanned by CamScanner

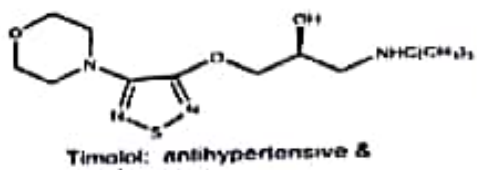
Adverse effects	1: Bronchoconstriction. 2: Hypotension. 3: Bradycardia and heart block. 4: Heart failure and physical fatigue due to decrease cardiac output. 5: Increase incidence of hypoglycaemic episodes in type I diabetics. 6: Cold extremities (symptoms of peripheral vascular disease) due to all adrenaline and nor-adrenaline act only in α receptors especially α_1 → VC 7: CNS effect → cross BBB → sleep disturbance. 8: Increase plasma conc. of LDL → Atherosclerosis → Angina 9: Sudden Stop β-blockers → Up-regulation of adrenoceptors → cardiac arrhythmia and hypertension (May cause sudden death).
Contraindication	1: Bronchial asthma. 2: Hypotension. 3: Heart Failure (Avoid large dose) 4: Partial heart blocker.

Nadolol (Corgard®)	**Timolol** (Timoge®)
- More potent than Propranolol - Less central effect due to fewer lipids soluble. - Longer duration of action.	- More potent than Propranolol. - Used in treatment of Chronic open-angle glaucoma.
Sotalol (Betacor®)	Antiarrhythmic and Antihypertensive.









Scanned by CamScanner

B1 Selective β1-adrenoceptor antagonist

Metoprolol (Betaloc®)

- Absorbed in GI
- Low bioavailability due to first-pass.
- Used once daily due to extend release.
- Used as Antihypertensive and anti-anginal

Atenolol (Atelol®)

- Water soluble drug → Not pass BBB
- Accumulation in renal tubules → Renal failure
- More effective in combination with diuretic.
- Used as Antihypertensive and anti-anginal

Q: Advantage of using selective β1 adrenoceptor antagonist in treatment of hypertension than non-selective?

A: They can be used in hypertension patient with:

1: Impaired pulmonary function.
2: Peripheral vascular disease.
3: Diabetic patient receiving insulin or oral hypoglycemic agents.

2: Arrhythmia associated with thyrotoxicosis.

- Adverse effect :-

1: Bradycardia
2: Heart failure

Used as Antihypertensive and anti-anginal.

- Adverse effect:-

→ Bradycardia, fatigue, vivid dreams and cold hands.

Betaxolol (Betoptic®)

- Long acting agent. - Used in glaucoma.

Bisoprolol (Concor®)

Used as Antihypertensive and anti-anginal.

سؤال

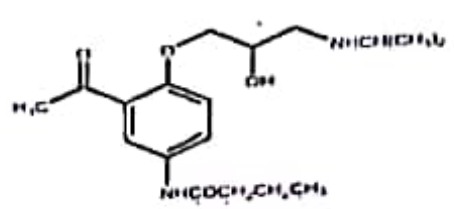
اسمه ميتوبرولول

السكسناك والترترات السكسناك حلقيه والترترات اليفاتية لمايجي لنا

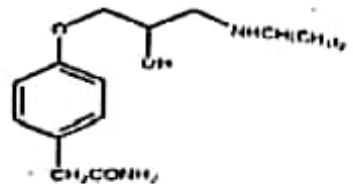
سكسناك وترترات هنا هواكش هل الاليفاتي ام الحلقي ؟!!!

الاكثر هو الاليفاتي لكن في حالة الـ engine نوطي سكسناك

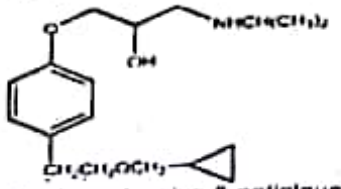
ترترات نحتاج دواء سريع



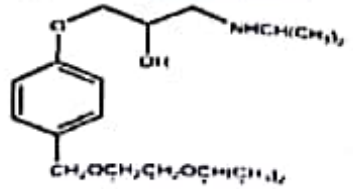
Acebutolol: antihypertensive



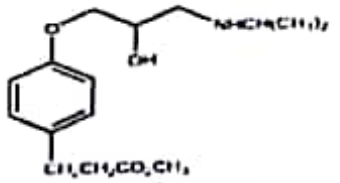
Atenolol: antihypertensive



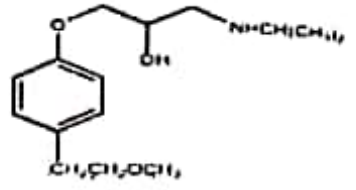
Betaxolol: antihypertensive & antiglaucoma



Bisoprolol: antihypertensive



Esmolol: short-acting antihypertensive



Metoprolol: antihypertensive

نفس الادوية ماعدا الاختلاف في رقم 4 في الكاتا رقم 4 صار pharmacokinetic يعني الاختلاف فقط بالجرعة

الاكثر هو polarity وجرعته اقل هنا البقية يجي بالـ 50 و 100 لانه يخرج بسرعة metoprolol بعده bisoprolol والذي بعده Esmolol والذي بعده acebutolol واكثر دواء duration طويل

الدواء الذي جرعته قليله ربح اكثر بالتسويق

واخق واوفر للمريض

136

betaxolol هو

Scanned by CamScanner